

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

REC'D 25 FEB 2005

WIPO

PCT

PCT

INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

BEST AVAILABLE COPY

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054071	WEITERES VORGEHEN siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12767	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.11.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 15.11.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		

1. Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.



2. Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 9 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

☒ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).

Diese Anlagen umfassen insgesamt 6 Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:

- I ☒ Grundlage des Bescheids
- II ☐ Priorität
- III ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV ☒ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags 28.05.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts 28.02.2005
Name und Postanschrift der mit der Internationalen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter Muellners, W Tel. +31 70 340-3289 

I. Grundlage des Berichts

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

Beschreibung, Seiten

1-22 in der ursprünglich eingereichten Fassung

Ansprüche, Nr.

1-13 eingegangen am 30.11.2004 mit Schreiben vom 29.11.2004

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
- ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).

3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:

- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
- ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
- ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
- ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
- ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.

4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

- ☐ Beschreibung, Seiten:
- ☐ Ansprüche, Nr.:
- ☐ Zeichnungen, Blatt:

5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

IV. Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung

1. Auf die Aufforderung zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren hat der Anmelder:
- ☐ die Ansprüche eingeschränkt.
 - ☐ zusätzliche Gebühren entrichtet.
 - ☐ zusätzliche Gebühren unter Widerspruch entrichtet.
 - ☐ weder die Ansprüche eingeschränkt noch zusätzliche Gebühren entrichtet.
2. ☒ Die Behörde hat festgestellt, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nicht erfüllt ist, und hat gemäß Regel 68.1 beschlossen, den Anmelder nicht zur Einschränkung der Ansprüche oder zur Zahlung zusätzlicher Gebühren aufzufordern.
3. Die Behörde ist der Auffassung, daß das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung nach den Regeln 13.1, 13.2 und 13.3
- ☐ erfüllt ist.
 - ☒ aus folgenden Gründen nicht erfüllt ist:
siehe Beiblatt
4. Daher wurde zur Erstellung dieses Berichts eine internationale vorläufige Prüfung für folgende Teile der internationalen Anmeldung durchgeführt:
- ☒ alle Teile.
 - ☐ die Teile, die sich auf die Ansprüche Nr. beziehen.

V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung

1. Feststellung
- | | |
|--------------------------------|---------------------|
| Neuheit (N) | Ja: Ansprüche 1-13 |
| | Nein: Ansprüche |
| Erfinderische Tätigkeit (IS) | Ja: Ansprüche 1-13 |
| | Nein: Ansprüche |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche: 1-13 |
| | Nein: Ansprüche: |

2. Unterlagen und Erklärungen:

siehe Beiblatt

zu Punkt IV

1.1 Im Lichte der Beschreibung (Seite 7, erster Absatz und Seite 9, letzter Absatz) und des Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die allgemeine der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung weiterer synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden zur Bekämpfung von Schadpilzen angesehen werden. Dabei wird zunächst die Bekämpfung von Mehltaupilzen besonders hervorgehoben.

1.2 Die tatsächlichen Beispiele richten sich aber auf andere und spezifischere Aufgaben nämlich die Bereitstellung weiterer hochwirksamer Mittel zur Bekämpfung von Reiskrankheiten und zur Bekämpfung von *Oomyceten* (siehe die Beschreibung Seite 10, die beiden ersten Absätze).

Die Beschreibung (siehe Seite 10, Absätze 3 und 4) hebt sogar ausdrücklich hervor, dass diese Aufgaben von der oben unter 1.1 hervorgehobenen Aufgabe deutlich verschieden sind und man deshalb nicht erwarten kann, dass die jeweiligen Lösungen übertragbar sind.

Entsprechendes lässt sich auch für das Verhältnis zwischen diesen beiden in den Beispielen gelösten Aufgaben sagen.

Pathogene die typische Reiskrankheiten auslösen wie *Pyricularia oryzae*, *Cochliobolus miyabeanus* und *Corticium sasakii* (syn. *Rhizoctonia solani*) sind *Ascomyceten* bzw. *Basidiomyceten* nicht *Oomyceten*. Andererseits sind typische *Oomyceten* wie *Phytophthora infestans* und *Plasmopara viticola* keine Reispathogene. Somit scheint bereits das a priori Einheitlichkeit herstellende gemeinsame besondere technische Merkmal des gesamten Anspruchsgegenstandes zu fehlen, nämlich dass er die gleiche Aufgabe löst. Es liegt also bereits a priori Uneinheitlichkeit vorliegt (Regel 13.1 und 13.2 PCT)

Es ist als reiner Zufall anzusehen, dass die beiden Aufgaben die gleiche Lösung haben. Da aber der Anspruchsgegenstand in seiner gegenwärtigen Definition durch diese zufällige Identität der Lösungen zwangsläufig beide Aufgaben löst, erübrigt sich eine Unterteilung aufgrund einer solchen Uneinheitlichkeit. Hierbei wird auch der Gegenstand der Ansprüche 8 und 9 als identisch betrachtet, da ein Verfahren lediglich durch die Verfahrensschritte gekennzeichnet ist. Die Absicht mit der ein Verfahren durchgeführt wird ist für das Verfahren als solches nicht von Belang. Im Unterschied dazu wären entsprechende Verwendungsansprüche (zur Bekämpfung von Reiskrankheiten bzw. zur Bekämpfung von *Oomyceten*) als voneinander verschiedene Erfindungsgegenstände zu

betrachten,

2. Darüber hinaus ist der Anspruchsgegenstand aber auch als a posteriori uneinheitlich zu betrachten.

Begründung:

Im folgenden wird der Anspruchsgegenstand als Lösung der ersten oben unter 1.2 angeführten spezifischen Aufgabe (Bekämpfung von Reiskrankheiten) betrachtet. Für eine Betrachtung als Lösung der zweiten spezifischen Aufgabe (Bekämpfung von *Oomyceten*) ergäben sich analoge Überlegungen.

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins der Formel I (im folgenden als TP1 bezeichnet) in Kombination mit einem fungiziden Azolderivat ausgewählt aus einer Liste von 17 solchen Derivaten gekennzeichnet.

D1 offenbart Kombinationen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel unter der auch TP1 fällt, mit unter anderem fungiziden Triazolderivaten. Bevorzugt haben die Triazolopyrimidine als Substituenten einen 2-Chlor-6-fluoro- oder einen 2,4,6-Trifluorophenyl- Substituenten. Bevorzugt und durch Beispiele belegte Verbindungen dieser Struktur sind das 2-Chloro-6-fluorophenyl-Analoge des TP1 der vorliegenden Anmeldung, das ebenfalls einen 7-(4-methylpiperid-1-yl-Substituenten trägt (im folgenden TPa genannt) und das 7-(1,1,1-trifluoropropyl-2-ylamino)-Analoge des TP1, das ebenfalls einen 2,4,6-Trifluorophenyl-Substituenten trägt, im folgenden TPb genannt.

Die bevorzugten Triazolderivate fallen unter eine Formel unter der auch die Azole gemäß Formel (III), (VIII) und (XVI) (Difenoconazole, Hexaconazole, Ipcoconazole) der vorliegenden Anmeldung fallen. Durch Beispiele belegt sind Mischungen mit Tebuconazole, das dem Azol der Formel VIII (Hexaconazole) nahesteht, Metconazole, das den Azolen der Formeln XVI und XVII (Ipconazole, Triticonazole) sehr nahesteht (es ist das Di-hydroderivat des Letzteren), Propiconazole, das dem Azol der Formel (III) (Difenoconazole) nahesteht, sowie Cyproconazole und Epoxiconazole (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D1).

Das dem gesamten Anmeldungsgegenstand gemeinsame technische Merkmal ist die Kombination des spezifischen Fungizids TP1 mit Fungiziden, die als Merkmal gemeinsam haben, dass sie sogenannte Conazole sind.

Hinsichtlich des letzteren ist festzustellen, dass das Vorliegen eines solchen Merkmal im Stand der Technik implizit als ausreichend angesehen wird, um für Gegenstände die dieses Merkmal teilen und sich nur in weiteren Details unterscheiden gleiche technische Effekte zu erwarten. D1 (siehe oben) illustriert das hinsichtlich synergistischer Effekte bereits durch die Tatsache, dass es eine allgemeine Formel für die Triazole verwendet. D2 illustriert diese Auffassung hinsichtlich allgemein in Aussicht stehender Vorteile von Kombinationen. Es wird dort nämlich vorgeschlagen die Verbindung TP1 mit fungiziden Azolen zu mischen. Aufgeführt werden sämtliche in der vorliegenden Anmeldung genannten Azole ausgenommen die der Formel XV und XVIII, auch genannt, und somit offenbar als äquivalent betrachtet, sind darüber hinaus die Beispielsverbindungen aus Entgegenhaltung D1: Tebuconazole, Metconazole, Cyproconazole, Epoxiconazole, und Propiconazole (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D2).

Entgegenhaltung D3 schließlich, die synergistische fungizide Mischungen gewisser Strobilurin-Derivate mit insgesamt 17 Azolen, nämlich die ersten 12 der vorliegenden Anmeldung zusammen mit den 5 beispielhaften der Entgegenhaltung D1, offenbart, bestärkt den Fachmann in der Annahme, dass hinsichtlich der Erzielung synergistischer Effekte auch letztere und erstere sich gegenseitig vertreten können (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D3).

Das daraus nicht geschlossen werden kann, dass von Strobilurinen völlig verschiedene Triazolopyrimidine konkret mit diesen Azolen ebenfalls synergistisch wirken würden, hindert den Fachmann nicht an der Schlussfolgerung, dass man grundsätzlich erwarten kann, dass sich Azole in Hinblick auf synergistischen Effekte gegenseitig vertreten können. Das Erfordernis der Einheitlichkeit der Erfindung (Artikel 34(3)(a) in Verbindung mit Regel 13.1 PCT) wäre demnach erfüllt.

Selbstverständlich müssen aber hinsichtlich der Klasse zu der die erste Komponente gehört, d.h. den Triazolopyrimidinen gleiche Maßstäbe angelegt werden, wie für die zweite Komponente, d.h. die Triazole.

TP1 teilt vergleichbare gemeinsame Merkmale mit den Triazolopyrimidinen TPa und TPb des Standes der Technik.

Wenn es für den Fachmann nicht naheliegend ist zur Lösung der Aufgabe in den in Entgegenhaltung D1 vorgeschlagenen Mischungen, die u.a. durch eine allgemeine Formel für Triazolopyrimidine, die auch TP1 umfasst, charakterisiert sind, das TPa oder TPb der konkreten Beispiele gegen das überlegene TP1 auszutauschen, weil er Übertragbarkeit nicht erwartet hätte, dann muss dies auch innerhalb des gegenwärtigen

Anspruchsgegenstandes hinsichtlich der verschiedenen Triazole gelten.

Erkennt man dem Anspruchsgegenstand zu, dass er insgesamt auf einer erfinderischen Tätigkeit beruht, ist jede der Kombination eine eigene Erfindung, das heißt sie war aus keiner der jeweils anderen herleitbar.

Daraus ergeben sich insgesamt 17 entsprechend definierte Erfindungen:

1. Fungizide Mischungen enthaltend als aktive Komponente das Triazolopyrimidin der Formel (I) des Anspruches 1 und ein Azolderivat oder dessen Salze oder Addukte der Formel II (Bromuconazole), entsprechende Verfahren etc.

17. und ein Azolderivat oder dessen Salze oder Addukte der Formel XVIII (Prothioconazole) ...

Da der gesamte Anmeldungsgegenstand recherchiert wurde und die Formulierung eines Prüfungsberichtes für sämtliche Gegenstände auf der Basis der gleichen Grundüberlegungen in analoger Weise erfolgen kann, sieht die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde keinen Anlass zur Zahlung weiterer Prüfungsgebühren aufzufordern.

zu Punkt V

In diesem Bescheid werden folgende im Recherchenbericht zitierten Entgegenhaltungen D1-D3 genannt; die Numerierung wird auch im weiteren Verfahren beibehalten:

D1 EP988790 A
D2 WO98/46607 A
D3 WO97/06678 A

Neuheit

Der gesamte Anspruchsgegenstand wird als neu angesehen (Artikel 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(2) PCT).

Der Stand der Technik offenbart nicht die Kombinationen des Triazolopyrimidins der Formel I (im folgenden TP1 genannt) mit einem der 17 aufgeführten Azolfungizide.

Erfinderische Tätigkeit

Die gesamte Anspruchsgegenstand wird als auf einer erfinderischen Tätigkeit beruhend angesehen (Artikel 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(3) PCT).

Die folgende Begründung geht von der ersten oben unter IV genannten Erfindung (Mischungen mit Bromuconazole) und der ersten oben unter IV-1.2 genannten Aufgabe aus (Bekämpfung von Reiskrankheiten).

Ausgehend von der zweiten Aufgabe (Bekämpfung von *Oomyceten*) ergäben sich analoge Überlegungen, die sich auf dem erheblichen, in der Beschreibung aber kaum belegten, Unterschied zwischen der Klasse der *Oomyceten* und den "echten" Pilzen der Klasse der *Ascomyceten* und *Basidiomyceten* stützen.

Entsprechende analoge Begründungen lassen sich für die übrigen oben unter IV definierten Erfindungen 2-17 formulieren.

Im Lichte der Beschreibung (insbesondere Seite 10, Zeilen 5-32) und des entsprechenden nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D2 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung von Triazolopyrimidin-Fungizide enthaltenden Mitteln zur Bekämpfung von Reiskrankheiten angesehen werden. Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit dem fungiziden Azolderivat Bromuconazole gekennzeichnet.

Der nächste Stand der Technik der Entgegenhaltung D2 offenbart Trifluorophenyl-triazolopyrimidine, darunter die Verbindung TP1. Es wird hervorgehoben (siehe D2, Seite 7, Zeilen 9-22), dass sie erhöhte Systemizität und Toxizität gegen Reiskrankheiten und Mehltau zeigen, besonders hervorgehoben wird die Eignung zur Bekämpfung des Mehltäupilzes *Uncinula necator*. In einem Vergleichsbeispiel wird gezeigt, dass sie dem 2-Chloro-6-fluorophenyl-Analogue des TP1 (im folgenden TPa genannt) in der Bekämpfung von *Uncinula necator* überlegen ist. Auch wird dort vorgeschlagen sie mit fungiziden Azolen zu mischen. Aufgeführt wird dort auch Bromuconazole (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegenhaltung D2).

D1 offenbart Kombinationen von Triazolopyrimidinen einer allgemeinen Formel unter der auch TP1 fällt, mit unter anderem fungiziden Triazolderivaten. Bevorzugt haben die Triazolopyrimidine als Substituenten einen 2-Chlor-6-fluoro- oder einen 2,4,6-Trifluorophenyl- Substituenten. Bevorzugt und durch Beispiele belegte Verbindungen dieser Struktur sind das 2-Chloro-6-fluorophenyl-Analogue des TP1 der vorliegenden Anmeldung,

das ebenfalls einen 7-(4-methylpiperid-1-yl-Substituenten trägt (TPa) und das 7-(1,1,1-trifluoropropyl-2-ylamino)-Analoge des TP1, das ebenfalls einen 2,4,6-Trifluorophenyl-Substituenten trägt. Als zu bekämpfende Pilze werden Arten der Gattungen *Blumeria*, *Botrytis*, *Septoria*, *Erysiphe* und *Puccinia* genannt deren erfolgreiche Bekämpfung auf Weizen, Gerste, Äpfeln, Gurken und Tomaten in Beispielen gezeigt wird.

Die bevorzugten Triazolderivate sind Cyproconazole, Epoxiconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole. Bromuconazole wird nicht ausdrücklich erwähnt (siehe die im Recherchenbericht zitierten Passagen der Entgegnung D1).

Angesichts der spezifischen Anforderungen an die Bekämpfung von Reiskrankheiten (siehe die Beschreibung der vorliegenden Anmeldung Seite 10, Zeilen 8-32) konnte der Fachmann nicht erwarten, dass die Kombination der aus D2 bekannten Verbindung TP1 mit dem Conazol Bromuconazole zu einem hochwirksamen Mittel zur Bekämpfung von Reiskrankheiten führen würde. Eine solche Mischung entspräche dem Austausch der in D1 verwendeten Triazolopyrimidine durch TP1, dessen Überlegenheit D2 aber nur hinsichtlich der Bekämpfung des Mehltäupilzes *Uncinula necator* demonstriert, bei gleichzeitigem Austausch der in D1 verwendeten Conazol-Mischungspartner durch das dort nicht erwähnte Bromuconazole, wobei obendrein D1 keine besondere Eignung seiner Kombinationen für die Bekämpfung von Reiskrankheiten nahelegt.

Industrielle Anwendbarkeit

Der Anspruchsgegenstand wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) und (4) PCT).

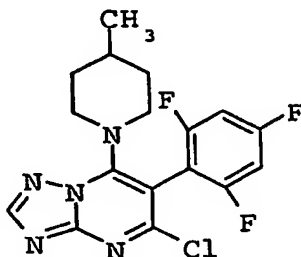
Patentansprüche

1. Fungizide Mischungen, enthaltend als aktive Komponenten

5

A) das Triazolopyrimidin-Derivat der Formel I,

10



I

15

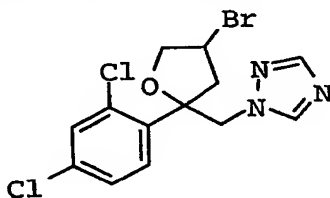
und

B) ein Azolderivat oder dessen Salze oder Addukte, ausgewählt aus

20

(1) Bromuconazole der Formel II

25

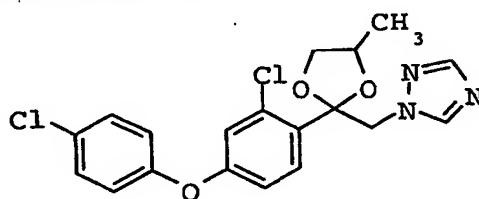


II

und

(2) Difenoconazole der Formel III

30



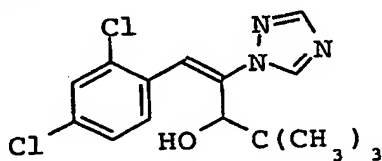
III

35

und

(3) Diniconazole der Formel IV

40



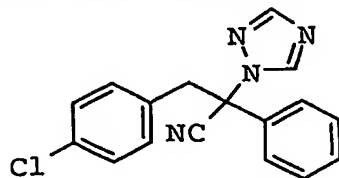
IV

und

45

24

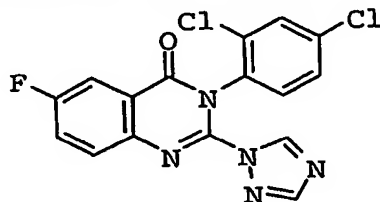
(4) Fenbuconazole der Formel V



V

und

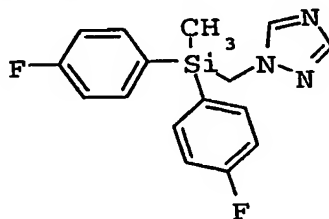
(5) Fluquinconazole der Formel VI



VI

und

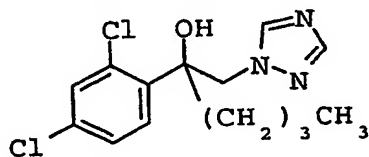
(6) Flusilazole der Formel VII



VII

und

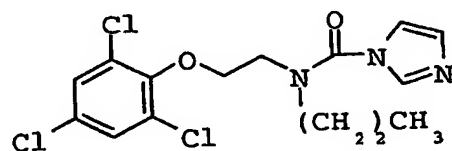
(7) Hexaconazole der Formel VIII



VIII

und

(8) Prochloraz der Formel IX

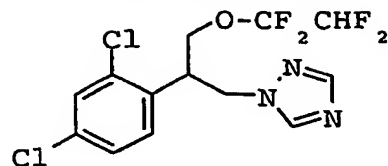


IX

und

25

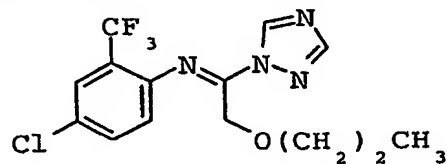
(9) Tetraconazole der Formel X



X

und

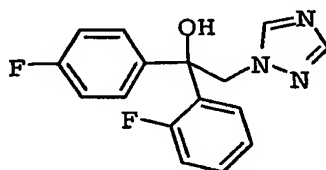
(10) Triflumizole der Formel XI



XI

und

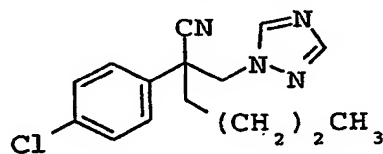
(11) Flutriafol der Formel XII



XII

und

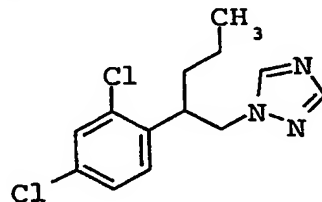
(12) Myclobutanil der Formel XIII



XIII

und

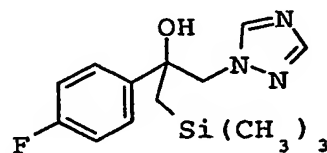
(13) Penconazole der Formel XIV



XIV

und

(14) Simeconazole der Formel XV



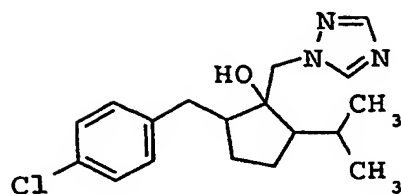
XV

26.

und

(15) Ipconazole der Formel XVI

5



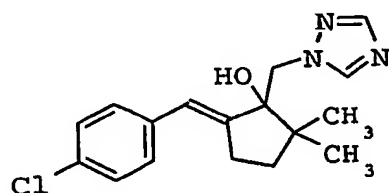
XVI

10

und

(16) Triticonazole der Formel XVII

15



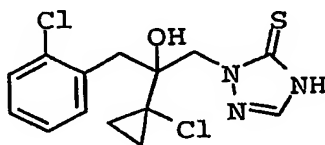
XVII

und

20

(17) Prothioconazole der Formel XVIII

25



XVIII

in einer synergistisch wirksamen Menge.

2. Fungizide Mischungen gemäß Anspruch 1, wobei das Azolderivat
ausgewählt ist aus der Gruppe

30

35

40

45

- (1) Bromuconazole,
- (3) Dimiconazole,
- (4) Fenbuconazole,
- (5) Fluquinconazole,
- (6) Flusilazole,
- (8) Prochloraz,
- (9) Tetraconazole,
- (10) Triflumizole,
- (11) Flutriafol,
- (12) Myclobutanil,
- (13) Penconazole,
- (14) Simeconazole und
- (17) Prothioconazole.

27

3. Fungizide Mischungen gemäß Anspruch 1, wobei das Azolderivat ausgewählt ist aus der Gruppe
- 5 (2) Difenoconazole,
(7) Hexaconazole,
(15) Ipconazole und
(16) Triticonazole.
- 10 4. Fungizide Mischungen gemäß Anspruch 1, wobei das Azolderivat ausgewählt ist aus der Gruppe
- 15 (13) Penconazole,
(14) Simeconazole,
(15) Ipconazole,
(16) Triticonazole und
(17) Prothioconazole.
- 20 5. Fungizide Mischungen gemäß Anspruch 1, wobei das Azolderivat ausgewählt ist aus der Gruppe
- (13) Penconazole,
(14) Simeconazole und
(17) Prothioconazole.
- 25 6. Fungizide Mischungen nach einem der Ansprüche 1 bis 5, dadurch gekennzeichnet, dass das Gewichtsverhältnis des Triazolopyrimidins der Formel I zu dem jeweiligen Triazol der Formeln II bis XVIII 100:1 bis 1:100 beträgt.
- 30 7. Fungizide Mittel, enthaltend die fungizide Mischungen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 sowie einen festen oder flüssigen Träger.
- 35 8. Verfahren zur Bekämpfung von reispfpathogenen Schadpilzen, dadurch gekennzeichnet, daß man die Schadpilze, deren Lebensraum oder die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Samen, Böden, Flächen, Materialien oder Räume mit dem Triazolopyrimidin der Formel I gemäß Anspruch 1 und Azolen der Formel II bis XVIII gemäß Anspruch 1 oder den Mitteln gemäß Anspruch 7
- 40 behandelt.
- 45 9. Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen aus der Klasse der Oomyceten dadurch gekennzeichnet, daß man die Schadpilze, deren Lebensraum oder die von ihnen freizuhaltenden Pflanzen, Samen, Böden, Flächen, Materialien oder Räume mit dem Triazolopyrimidin der Formel I gemäß Anspruch 1

28

und Azolen der Formel II bis XVIII gemäß Anspruch 1 oder den Mitteln gemäß Anspruch 7 behandelt.

10. Verfahren nach Ansprüchen 8 oder 9, dadurch gekennzeichnet,
5 daß man die Verbindung der Formel I gemäß Anspruch 1 und mindestens eine Verbindung der Formel II bis XVIII gemäß Anspruch 1 gleichzeitig, und zwar gemeinsam oder getrennt, oder nacheinander ausbringt.
- 10 11. Verfahren nach einem der Ansprüche 8 bis 10, dadurch gekennzeichnet, daß man die fungizide Mischung oder die Verbindung der Formel I mit mindestens einer Verbindung der Formel II bis XVIII gemäß Anspruch 1 in einer Menge von 5 bis 2000 g/ha aufwendet.
- 15 12. Saatgut enthaltend die Mischung gemäß einem der Ansprüche 1 bis 6 in einer Menge von 1 bis 1000 g/100 kg.
- 20 13. Verwendung der Verbindungen I und II bis XVIII gemäß Anspruch 1 zur Herstellung eines fungiziden Mittels gemäß Anspruch 7.

25

30

35

40

45

Translation

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2003/012767



PCT

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 0000054071	FOR FURTHER ACTION See Form PCT/IPEA/416	
International application No. PCT/EP2003/012767	International filing date (day/month/year) 14 November 2003 (14.11.2003)	Priority date (day/month/year) 15 November 2002 (15.11.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A01N 43/90		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		

<p>1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>9</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p>3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:</p> <p>a. <input checked="" type="checkbox"/> (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of <u>6</u> sheets, as follows:</p> <p><input type="checkbox"/> sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).</p> <p><input type="checkbox"/> sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.</p> <p>b. <input type="checkbox"/> (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) _____, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).</p>	
<p>4. This report contains indications relating to the following items:</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. I Basis of the report</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. II Priority</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. III Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. IV Lack of unity of invention</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> Box No. V Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VI Certain documents cited</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VII Certain defects in the international application</p> <p><input type="checkbox"/> Box No. VIII Certain observations on the international application</p>	

Date of submission of the demand 28 May 2004 (28.05.2004)	Date of completion of this report 28 February 2005 (28.02.2005)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/EP2003/012767

Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

☐ This report is based on translations from the original language into the following language _____, which is language of a translation furnished for the purpose of:

- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

☒ The international application as originally filed/furnished

☒ the description:

pages _____ 1-22 _____, as originally filed/furnished

pages* _____ received by this Authority on _____

pages* _____ received by this Authority on _____

☒ the claims:

pages _____, as originally filed/furnished

pages* _____, as amended (together with any statement) under Article 19

pages* _____ 1-13 _____ received by this Authority on 30 November 2004 (30.11.2004)

pages* _____ received by this Authority on _____

☐ the drawings:

pages _____, as originally filed/furnished

pages* _____ received by this Authority on _____

pages* _____ received by this Authority on _____

☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

☐ the description, pages _____

☐ the claims, Nos. _____

☐ the drawings, sheets/figs _____

☐ the sequence listing (*specify*): _____

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

☐ the description, pages _____

☐ the claims, Nos. _____

☐ the drawings, sheets/figs _____

☐ the sequence listing (*specify*): _____

☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): _____

* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

1.1 In the light of the description (page 7, first paragraph; and page 9, last paragraph) and the prior art in citation D1, the general problem addressed by the application can be considered that of providing further synergistic mixtures of triazolopyrimidines with other fungicides for the control of harmful fungi. The control of mildews is especially emphasised in the first instance.

1.2 The actual examples are, however, directed to other and more specific problems, namely the provision of further highly effective agents for the control of rice diseases and for the control of *Oomycetes* (see the first two paragraphs on page 10 of the description).

The description (see page 10, third and fourth paragraphs) even explicitly emphasises the fact that these problems are markedly different from the problem emphasised in 1.1 above, and that the solutions cannot therefore be expected to be applicable from one case to another.

The same also applies *mutatis mutandis* to the relationship between these two problems solved in the examples.

Pathogens causing typical rice diseases, for example *Pyricularia oryzae*, *Cochliobolus miyabeanus* and *Corticium sasakii* (syn. *Rhizoctonia solani*), are *Ascomycetes* or *Basidiomycetes* but not *Oomycetes*, whereas typical *Oomycetes* such as *Phytophthora infestans* and *Plasmopara*

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 03/12767

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

viticola are not rice pathogens. The subject matter of the claims as a whole therefore already appears to lack the common special technical feature that establishes unity of invention *a priori*, i.e. one that solves the same problem. There is therefore already lack of unity *a priori* (PCT Rule 13.1 and 13.2).

It must be considered pure chance that the two problems have the same solution. Since the subject matter of the claims as defined at present necessarily solves both problems as a result of this chance identity of the solutions, a subdivision on the basis of such a lack of unity is superfluous. The subject matter of claims 8 and 9 is also considered to be identical, since a method is characterised merely by the method steps. The intention with which a method is carried out is of no importance for the method *per se*. By contrast, corresponding use claims (for the control of rice diseases and for the control of *Oomycetes* respectively) would have to be regarded as differing subjects of the invention.

2. However, the subject matter of the claims also has to be regarded as lacking unity of invention *a posteriori*.

Reasons:

The subject matter of the claims is hereinafter deemed to be a solution to the first specific problem indicated under 1.2 above (control of rice diseases). Similar considerations would apply if the subject matter were deemed to be a solution to the second specific problem

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 03/12767

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

(control of *Oomycetes*).

The proposed solution is characterised by the use of the specific triazolopyrimidine of formula I (hereinafter referred to as TP1) in combination with a fungicidalazole derivative selected from a list of 17 such derivatives.

D1 discloses combinations of triazolopyrimidines of a general formula which also covers TP1 with *inter alia* fungicidal triazole derivatives. The triazolopyrimidines preferably have as substituent a 2-chloro-6-fluorophenyl or a 2,4,6-trifluorophenyl substituent. Compounds of this structure which are preferred and exemplified are the 2-chloro-6-fluorophenyl analogue of TP1 in the present application, which likewise has a 7-(4-methylpiperid-1-yl) substituent (hereinafter referred to as TPa), and the 7-(1,1,1-trifluoroprop-2-ylamino) analogue of TP1, which likewise has a 2,4,6-trifluorophenyl substituent (hereinafter referred to as TPb).

The preferred triazole derivatives are covered by a formula which also covers the azoles according to formulae III, VIII and XVI (difenoconazole, hexaconazole, ipconazole) in the present application. Mixtures which are exemplified are those with tebuconazole, which is similar to the azole of formula VIII (hexaconazole), metconazole, which is very similar to the azoles of formulae XVI and XVII (ipconazole, triticonazole) (metconazole is the dihydro derivative of triticonazole), propiconazole, which is similar to the azole of

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

formula III (difenoconazole), and cyproconazole and epoxiconazole (see the passages in D1 cited in the search report).

The technical feature common to the subject matter of the claims as a whole is the combination of the specific fungicide TP1 with fungicides having as their common feature the fact that they are "conazoles".

With regard to the latter point, it should be emphasised that the presence of such a feature in the prior art is implicitly considered to be sufficient basis for expecting physical entities which share this feature and differ only in further details to have the same technical effects. D1 (see above) illustrates this with regard to synergistic effects by virtue of the fact that it uses a general formula for the triazoles. D2 illustrates this viewpoint with regard to generally expected advantages of combinations, since it proposes mixing the compound TP1 with fungicidal azoles. All the azoles referred to in the present application are listed, apart from those of formulae XV and XVIII; also mentioned, moreover, and thus evidently considered equivalent, are the exemplary compounds from citation D1, namely tebuconazole, metconazole, cyproconazole, epoxiconazole and propiconazole (see the passages in D2 cited in the search report).

Citation D3, lastly, which discloses synergistic fungicidal mixtures of certain strobilurin derivatives with a total of 17 azoles, namely the first 12 in the

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.
PCT/EP 03/12767Supplemental Box
(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

present application and the five exemplary azoles from citation D1, confirms the assumption of a person skilled in the art that the latter compounds and former compounds are also interchangeable with respect to the attainment of synergistic effects (see the passages in D3 cited in the search report).

Although this does not signify that triazolopyrimidines which are completely different from strobilurins would also produce a synergistic effect with these azoles specifically, a skilled person may still conclude that azoles can normally be expected to be interchangeable in terms of their synergistic effects. The requirement of unity of invention (PCT Article 34(3)(a) in conjunction with Rule 13.1) would accordingly be satisfied.

It is, however, self-evident that the criteria applied to the class to which the first component belongs, that is to say the triazolopyrimidines, must be the same as those applied to the class to which the second component belongs, that is to say the triazoles.

TP1 has comparable features in common with the prior art triazolopyrimidines TPa and TPb.

If, in the mixtures proposed in citation D1 and characterised *inter alia* by a general formula for triazolopyrimidines which also includes TP1, it is not obvious to a skilled person to replace the TPa or TPb of the specific examples with the superior TP1 to solve the problem because he would not have expected applicability,

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 03/12767

Supplemental Box

(To be used when the space in any of the preceding boxes is not sufficient)

Continuation of: IV.3

then this must also be true of the different azoles within the subject matter of the present claims.

If an inventive step is acknowledged in respect of the subject matter of the claims as a whole, each of the combinations is a separate invention; that is to say, none was deducible from any of the others.

This yields a total of 17 inventions:

1. Fungicidal mixtures containing as active component the triazolopyrimidine of formula I in claim 1 and an azole derivative or salts or adducts thereof of formula II (bromuconazole), corresponding methods, etc.

17. ... and an azole derivative or salts or adducts thereof of formula XVIII (prothioconazole) ...

Since the whole of the subject matter of the application has been searched, and since an examination report can be similarly established for all the subjects on the basis of the same fundamental considerations, the International Preliminary Examining Authority sees no reason to invite the applicant to pay further examination fees.

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 03/12767

V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-13	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-13	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-13	YES
	Claims		NO

2. Citations and explanations

The following search report citations D1 to D3 are specified in this report; the same numbering will be used throughout the procedure:

D1: EP988790 A

D2: WO98/46607 A

D3: WO97/06678 A

Novelty

The subject matter of all the claims is considered novel (PCT Article 33(1) in conjunction with PCT Article 33(2)).

The prior art does not disclose the combinations of the triazolopyrimidine of formula I (hereinafter referred to as TP1) with one of the 17 azole fungicides listed.

Inventive step

The subject matter of all the claims is considered to involve an inventive step (PCT Article 33(1) in conjunction with PCT Article 33(3)).

The following reasons are based on the first invention referred to in Box IV above (mixtures with bromuconazole) and the first problem referred to in point 1.2 of Box IV

above (control of rice diseases).

Proceeding from the second problem (control of *Oomycetes*), similar considerations would arise on the basis of the difference between the *Oomycetes* class and the "true" fungi of the *Ascomycetes* and *Basidiomycetes* class, which is a significant difference but one that is barely substantiated in the description.

Analogous reasons can be stated for the other inventions 2 to 17 defined in Box IV above.

In the light of the description (especially page 10, lines 5 to 32) and the corresponding closest prior art in citation D2, the problem addressed by the application can be considered that of providing agents containing triazolopyrimidine fungicides for the control of rice diseases.

The proposed solution is characterised by the use of the specific triazolopyrimidine TP1 in combination with the fungicidal azole derivative bromuconazole.

The closest prior art in citation D2 discloses trifluorophenyl-triazolopyrimidines, including the compound TP1. Their enhanced systemicity and toxicity against rice diseases and mildew are emphasised (see D2, page 7, lines 9 to 22). Their suitability for the control of the mildew *Uncinula necator* is particularly emphasised. A comparative example shows that they are superior to the 2-chloro-6-fluorophenyl analogue of TP1 (hereinafter referred to as TPa) in the control of *Uncinula necator*. D2 also proposes mixing them with fungicidal azoles. Bromuconazole is also listed there (see the passages in D2 cited in the search report).

D1 discloses combinations of triazolopyrimidines of a general formula which also covers TP1 with *inter alia* fungicidal triazole derivatives. The triazolopyrimidines preferably have as substituent a 2-chloro-6-fluorophenyl or a 2,4,6-trifluorophenyl substituent. Compounds of this structure which are preferred and exemplified are the 2-chloro-6-fluorophenyl analogue of TP1 in the present application, which likewise has a 7-(4-methylpiperid-1-yl) substituent (TPa), and the 7-(1,1,1-trifluoroprop-2-ylamino) analogue of TP1, which likewise has a 2,4,6-trifluorophenyl substituent. Species of the genera *Blumeria*, *Botrytis*, *Septoria*, *Erysiphe* and *Puccinia* are mentioned as fungi to be controlled, and their successful control in wheat, barley, apples, cucumbers and tomatoes is demonstrated in examples.

The preferred triazole derivatives are cyproconazole, epoxiconazole, metconazole, propiconazole and tebuconazole. Bromuconazole is not explicitly mentioned (see the passages in D1 cited in the search report).

In view of the specific requirements for the control of rice diseases (see page 10, lines 8 to 32, of the description in the present application) a person skilled in the art could not have expected the combination of compound TP1 known from D2 with the conazole bromuconazole to lead to a highly effective agent for the control of rice diseases. A mixture of this kind would be equivalent to replacing the triazolopyrimidines used in D1 with TP1, the superiority of which D2 demonstrates only in respect of the control of the mildew *Uncinula necator* however, while at the same time replacing the conazole components used in the D1 mixtures by bromuconazole, which is not mentioned therein; what is more, D1 does not suggest that

INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 03/12767

its combinations are especially suitable for the control of rice diseases.

Industrial applicability

The subject matter of the claims is considered to be industrially applicable (PCT Article 33(1) and (4)).

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning
Operations and is not part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- ☐ BLACK BORDERS
- ☐ IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- ☒ FADED TEXT OR DRAWING
- ☒ BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING
- ☐ SKEWED/SLANTED IMAGES
- ☐ COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS
- ☐ GRAY SCALE DOCUMENTS
- ☐ LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT
- ☒ REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY
- ☐ OTHER: _____

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.